

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国际局

(43) 国际公布日:

2004年7月15日(15.07.2004)

PCT

(10) 国际公布号:

WO 2004/058770 A1

(51) 国际分类号: C07D 493/04, 493/22, A61K 31/34

(21) 国际申请号: PCT/CN2003/000095

(22) 国际申请日: 2003年1月28日(28.01.2003)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权: 02160524.6 2002年12月27日(27.12.2002) CN

(71) 申请人(对除美国以外的所有指定国): 中国科学院
上海药物研究所(SHANGHAI INSTITUTE OF
MATERIA MEDICA, CHINESE ACADEMY OF
SCIENCES) [CN/CN]; 中国上海市太原路294号,
Shanghai 200031 (CN)。

(72) 发明人: 及

(75) 发明人/申请人(仅对美国): 李援朝(LI, Yuanchao)
[CN/CN]; 左建平(ZUO, Jianping) [CN/CN]; 张凡
(ZHANG, Fan) [CN/CN]; 周如(ZHOU, Ru) [CN/CN];
丁健(DING, Jian) [CN/CN]; 中国上海市太原路294号
中国科学院上海药物研究所, Shanghai 200031
(CN)。(74) 代理人: 隆天国际知识产权代理有限公司(LUNG TIN
INTERNATIONAL INTELLECTUAL PROPERTY
AGENT LTD.); 中国北京市朝阳区慧忠路5号远大
中心B座18层, Beijing 100101 (CN)。(81) 指定国(国家): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA,
BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CO, CR, CU, CZ, DE,
DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ,
LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO,
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT,
TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW(84) 指定国(地区): ARIPO专利(GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚专利(AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲专利(AT,
BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR),
OAPI专利(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

根据细则4.17的声明:

— 关于申请人在国际申请日有权申请并被授予专利(细则
4.17(ii))对除美国以外的所有指定国
— 发明人资格(细则4.17(iv))仅对美国

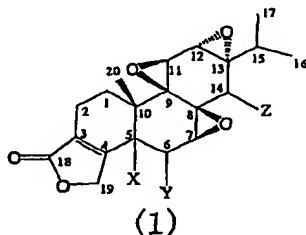
本国际公布:

— 包括国际检索报告。

所引用双字母代码和其它缩写符号, 请参考刊登在每期
PCT公报期刊起始的“代码及缩写符号简要说明”。

(54) Title: TRIPTOLIDE DERIVATIVES AND THEIR USE

(54) 发明名称: 雷公藤内酯醇衍生物及其应用



(1)

(57) Abstract: Triptolide derivatives of Formula (I), their pharmaceutically acceptable salts and optical isomers, Formula (I), (wherein, C5 and C6 connect with each other by a C-C single bond or double bond; when C5 and C6 are connected with C-C single bond, X and Y represents independently hydrogen, oxygen, hydroxy, halogen, lower alkyloxy, lower alkylamino, mercapto, lower alkylthio, the group of formula -OCOR, -OSO₂OR or -OPO(OH)₂, each of which is attached to C5 and C6, R represents -(CH₂)_nCO₂Na, -(CH₂)_nCO₂K or -(CH₂)_nCH₃, wherein n = 1-6; Z represents hydrogen, oxygen, hydroxy, halogen, lower alkyloxy, lower alkylamino, mercapto, lower alkylthio, the group of formula -OCOR, -OSO₂OR or -OPO(OH)₂, each of which is linked at C14-position, R represents -(CH₂)_nCO₂Na, -(CO₂)_nCO₂K, or -(CH₂)_nCH₃, wherein n = 1-6; wherein, the " " linked with X, Y, and Z represents " " or " ", provided that X and Y cannot both be hydrogen atom at the same time), the methods for preparing them and their use as antiphlogistic agent, immunosuppressive agent or therapeutic agent for other related diseases.

[见续页]